

生体内での選択的アミド化反応による薬剤の現地合成

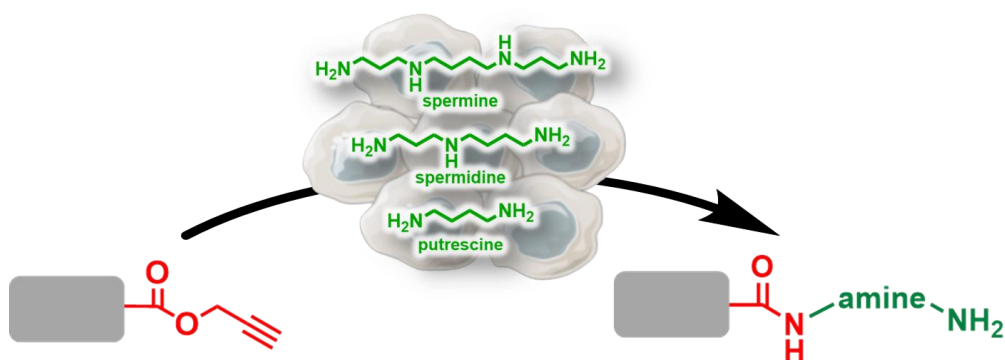
(東工大物質理工¹・理研 開拓研究本部 田中生体研²) ○松浦 淳紘¹・プラディプタ アンバラ¹・田中 克典^{1,2}

On-site synthesis of cancer drug via in vivo amidation reaction. (¹*School of Materials and Chemical Technology, Tokyo Institute of Technology*, ²*Biofunctional Synthetic Chemistry Laboratory, Cluster for Pioneering Research, RIKEN*) ○Atsuhiro Matsuura,¹ Ambara R. Pradipta,¹ Katsunori Tanaka,^{1,2}

We previously reported that propargylic esters could selectively react with polyamines, biogenic amines that are highly generated in cancer cells.^{1,2} In this study, we aim to synthesize drug molecules directly in cancer cells using the reaction. The details will be reported at the symposium.

Keywords : Cancer therapy; Polyamine; Propargylic ester; Prodrug; In vivo synthesis

がん細胞ではポリアミンが高濃度で存在していることが知られている。当研究室ではプロパルギルエステルが水中で縮合剤や触媒を必要とせずポリアミンと選択的に反応することでアミド結合を効率的に形成することを発見した。この反応を用いて抗がん活性を持つ薬剤分子をがん細胞で現地合成することで副作用の少ない抗がん剤治療を行うことができると考え、プロドラッグの合成と評価に着手したのでこれらの経緯と結果について報告する。



- 1) K. K. H. Vong, S. Maeda, K. Tanaka. *Chem. Eur. J.* **2016**, 22, 18865.
- 2) K. K. H. Vong, K. Tsubokura, Y. Nakao, T. Tanei, S. Noguchi, S. Kitazume, N. Taniguchi, K. Tanaka. *Chem. Commun.* **2017**, 53, 8403.